

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL****OXYRAPID Inyección****Oxycodona clorhidrato 10 mg/1 mL****Solución para inyección y perfusión**

Industria: Israelí

Vía de administración: Intravenosa **o subcutánea.****FÓRMULA CUALI CUANTITATIVA OxyRapid Inyección - cada mL contiene:**

Cada mL contiene:

Oxicodona **clorhidrato**.....10,0 mg

Excipientes:

Citrato sódico 1,0 mg, ácido cítrico monohidratado 0,3 mg, cloruro sódico 6,9 mg, ácido clorhídrico c.s., hidróxido sódico c.s., agua estéril para inyección hasta 1 mL.

**INDICACIONES Y USO**Dolor **moderado a severo** que requiere el uso de analgésicos opioides.**ACCIÓN FARMACOLÓGICA****Mecanismo de acción**

El efecto terapéutico es principalmente analgésico, ansiolítico, antitusígeno y sedante. El mecanismo de acción involucra receptores del sistema nervioso central opioides para compuestos endógenos con actividad opioide.

**Farmacodinamia**

Oxicodona **clorhidrato** es un agonista opiáceo sin acción antagónica. Sus efectos son similares a los de la morfina.

*Sistema Endocrino*

Los opiáceos pueden influir en los ejes hipotalámico pituitario adrenal o ejes gonadales. Algunos cambios que se observan incluyen un aumento en la prolactina sérica y disminuyen en plasma cortisol y testosterona. Los síntomas clínicos pueden ser manifiestos desde estos cambios hormonales.

*Sistema Gastrointestinal*

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL

---

Los opiáceos pueden inducir espasmo del esfínter de Oddi.

### *Otros Efectos Farmacológicos*

Estudios in vitro y animales indican varios efectos de los opiáceos naturales, como la morfina, en los componentes del sistema inmune; la significación clínica de estos hallazgos es desconocida. Se desconoce si la Oxycodona, un opiáceo semisintético, tiene efectos inmunológicos similares a la morfina.

### **Farmacocinética**

La Oxycodona es metabolizada en el hígado a través de CYP3A4 y CYP2D6 a noroxycodona, oximorfona y noroximorfona, que son posteriormente glucuronidados. NorOxycodona y la noroximorfona son los principales metabolitos circulantes. NorOxycodona es un agonista opioide mu débil. Noroximorfona es un agonista opioide mu potente; sin embargo, no cruza la barrera hematoencefálica de forma significativa. Oximorfona es un agonista opioide mu potente pero está presente en concentraciones muy bajas después de la administración de la Oxycodona. Ninguno de estos metabolitos se cree que contribuyen significativamente al efecto analgésico de la Oxycodona. El fármaco activo y sus metabolitos se excretan en la orina y las heces. Las concentraciones plasmáticas de Oxycodona son afectadas nominalmente sólo por edad, siendo un 15% mayor en personas de edad avanzada en comparación con sujetos jóvenes.

Sujetos femeninos tienen, en promedio, concentraciones de Oxycodona de plasma hasta un 25% más alto que los hombres en una base de peso ajustado de cuerpo.

En comparación con sujetos normales, pacientes con disfunción hepática leve a grave pueden tener mayores concentraciones plasmáticas de Oxycodona y norOxycodona y menores concentraciones de plasma de la oximorfona. Puede haber un aumento de la vida media de eliminación de Oxycodona, y esto puede ir acompañado de un aumento en los efectos de drogas.

En comparación con sujetos normales, pacientes con disfunción renal leve a grave pueden tener mayores concentraciones plasmáticas de Oxycodona y sus metabolitos. Puede haber un aumento de la vida media de eliminación de Oxycodona, y esto puede ir acompañado de un aumento en los efectos de drogas.

### **DATOS PRECLÍNICOS**

#### *Teratogenicidad*

La Oxycodona no tuvo efecto sobre la fertilidad o el desarrollo embrionario temprano en ratas machos y hembras a dosis de 8 mg/kg/día. Además, la Oxycodona no indujo ninguna malformación en ratas a dosis de 8 mg/kg/día o en conejos a dosis más altas que 125 mg/kg/día. Se observaron

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL

---

aumentos de dosis relacionadas en variaciones de desarrollo (mayor incidencia de vértebras presacras extra (27) y extras pares de costillas) en conejos cuando se analizaron los datos para los fetos. Sin embargo, cuando los mismos datos se analizaron usando crías en comparación con los fetos, no hubo ningún aumento relacionado con la dosis en las variaciones del desarrollo aunque la incidencia de vértebras presacras adicional seguía siendo significativamente mayor en el grupo de 125 mg/kg/día frente al grupo de control. Puesto que este nivel de dosis se asoció con severos efectos farmacotóxicos en los animales preñados, los resultados fetales han sido una consecuencia secundaria de la toxicidad materna grave.

### *Carcinogenicidad*

No se han realizado estudios en animales para evaluar el potencial carcinogénico de Oxycodona.

### *Mutagenicidad*

**La oxycodona no fue mutagénica en test de mutación bacteriana o en ensayos de micronúcleos in vivo en ratones. Como ocurre con otros opioides, la oxycodona demostró ser genotóxica en algunos ensayos in vitro (por ejemplo, en ensayo de linfoma de ratón y en ensayo de aberración cromosómica en linfoma humano)**

## DOSIS Y ADMINISTRACIÓN

### *General*

#### *Pacientes con insuficiencia renal o hepática*

La iniciación de la dosis debe seguir un enfoque conservador en estos pacientes. La dosis inicial adulta recomendada debe reducirse en un 50% (por ejemplo una dosis diaria total de 10 mg por vía oral en pacientes naïve opiáceos), y cada paciente debe ser ajustado a un control adecuado del dolor según su situación clínica.

La dosis debe ser ajustada de acuerdo a la severidad del dolor, la condición total del paciente y la medicación anterior o concurrente.

#### *Adultos mayores de 18 años*

Se recomiendan las siguientes dosis iniciales. Un aumento gradual de la dosis puede ser necesario si la analgesia es insuficiente o si la intensidad del dolor aumenta.

i.v. (Bolo): Diluir a 1 mg/ml en 0,9% de solución salina, dextrosa al 5% o agua para preparaciones inyectables. Administrar una dosis en bolo de 1 a 10 mg lentamente durante 1 a 2 minutos.

**Las dosis no deben ser administradas más frecuentemente que cada 4 horas.**

i.v. (**Perfusión**) Diluir a 1 mg/ml en 0,9% de solución salina, dextrosa al 5% o agua para preparaciones inyectables. Una dosis inicial de 2 mg/hora es recomendada.

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

i.v. (PCA): Diluir a 1 mg/ml en 0,9% de solución salina, dextrosa al 5% o agua para preparaciones inyectables. Las dosis de bolo de 0,03 mg/kg deben ser administradas con un tiempo de bloqueo mínimo de 5 minutos.

s.c. (Bolo): Utilizar como una concentración de 10mg/ml. Una dosis inicial de 5 mg es recomendada, repetida en intervalos de 4 horas conforme requerido.

s.c. (**Perfusión**) Diluir en 0,9% de solución salina, dextrosa al 5% o agua para inyecciones si es necesario. Se recomienda una dosis inicial de 7,5 mg / día en los pacientes opioides no tratados previamente, titulando gradualmente de acuerdo con el control de síntomas. Los pacientes con cáncer que han cambiado para Oxycodona oral pueden requerir dosis mucho más altas (ver más abajo).

Ref.: RF793346/16                      Reg. I.S.P. N° F-23489/17  
**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**  
**OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

*Transferencia de pacientes entre Oxycodona oral y parenteral*

La dosis deben ser basadas en la siguiente relación: 2 mg de Oxycodona oral es equivalente a 1 mg de Oxycodona parenteral. Hay que destacar que se trata de una guía para la dosis requerida. La variabilidad interpaciente requiere que cada paciente sea cuidadosamente titulado a la dosis apropiada.

*Pacientes ancianos*

Los pacientes ancianos deben ser tratados con precaución. La dosis más baja debe ser administrada con cuidado a la titulación para el control del dolor.

*Niños menores de 18 años*

No hay datos sobre el uso de la inyección de OxyRapid en pacientes menores de 18 años de edad.

*Uso en el dolor no maligno*

Los opioides no son la terapia de primera línea para el dolor crónico no maligno, ni son recomendados como el único tratamiento.

Los tipos de dolor crónico que se han demostrado para ser aliviado por opioides fuertes incluyen el dolor artrósico crónico y la enfermedad del disco intervertebral. La necesidad de continuar el tratamiento en el dolor no maligno debe ser evaluada a intervalos regulares

*Duración del tratamiento*

La Oxycodona no debe ser utilizada durante más tiempo de lo necesario.

*Interrupción del tratamiento*

Cuando un paciente ya no requiere el tratamiento con Oxycodona, puede ser aconsejable disminuir la dosis gradualmente para evitar síntomas de abstinencia

**CONTRAINDICACIONES**

Oxycodona está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida a la Oxycodona, o a cualquiera de los excipientes de la composición. Oxycodona no debe ser utilizada en cualquier situación donde están contraindicados los opiáceos:

- enfermedad pulmonar obstructiva crónica severa
- cor pulmonale
- asma bronquial **severa**

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

- depresión respiratoria severa con hipoxia y/o hipercapnia
- íleo paralítico.
- **Traumatismo craneal.**
- **Abdomen agudo.**
- **Retraso del vaciado gástrico.**

**ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES**

El mayor riesgo del exceso de opioide es la depresión respiratoria. Debe ejercerse precaución al administrar Oxycodona a los ancianos debilitados; pacientes con severo deterioro de la función pulmonar; pacientes con deterioro de la función hepática o renal; pacientes con mixedema, hipotiroidismo, enfermedad de Addison, hipertrofia de próstata, alcoholismo, psicosis tóxica, delirium tremens, pancreatitis, hipotensión, lesión en la cabeza (debido al riesgo de aumento de la presión intracraneal) o pacientes tomando inhibidores de MAO.

El paciente puede desarrollar tolerancia a la droga con el uso crónico y requerir dosis progresivamente más altas para mantener el control del dolor. El uso prolongado de este producto [preparación] puede conducir a dependencia física y puede ocurrir un síndrome de abstinencia en la abrupta interrupción de la terapia. Cuando un paciente ya no requiere el tratamiento con Oxycodona, puede ser aconsejable disminuir la dosis gradualmente para evitar síntomas de abstinencia.

La Oxycodona tiene un perfil de abuso similar a otros opioides agonistas fuertes. La Oxycodona puede ser buscada y abusada por personas con trastornos de adicción latentes o manifiestas. Existe potencial para el desarrollo de dependencia psicológica [adicciones] a los analgésicos opiáceos, como la Oxycodona. Oxyrapid debe utilizarse con especial cuidado en pacientes con antecedentes de abuso de alcohol y drogas.

El abuso de las formas de dosificación oral por administración parenteral puede esperarse resultando en serios eventos adversos, que pueden ser fatales.

Oxyrapid debe utilizarse con precaución pre o intra operatoriamente y dentro de las primeras 12-24 horas postoperatoriamente.

*Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas*

Oxycodona puede afectar la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL

---

### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Puede haber un efecto depresor **umentado** del SNC durante la terapia concomitante con fármacos que afectan el SNC tales como alcohol, otros opioides, sedantes, hipnóticos, antidepresivos, fenotiazinas y drogas neurolépticas, etc.

**La administración concomitante de oxycodona con anticolinérgicos o medicamentos con actividad anticolinérgica (por ej. antidepresivos tricíclicos, antihistamínicos, antipsicóticos, relajantes musculares, antiparkinsonianos) pueden dar lugar a un aumento de los efectos adversos anticolinérgicos. Oxycodona debe utilizarse con precaución y puede ser necesario reducir la dosis en pacientes que utilizan estos medicamentos.**

**Es conocido que los inhibidores de la monoaminooxidasa interactúan con los analgésicos opioides produciendo excitación o depresión del SNC asociada con crisis hipertensiva o hipotensora.**

**Oxycodona se debe utilizar con precaución en los pacientes a los que se les administra IMAO o que hayan recibido IMAO durante las dos últimas semanas.**

**El alcohol puede aumentar los efectos farmacodinámicos de Oxycodona solución inyectable, se debe evitar el uso concomitante.**

La Oxycodona es metabolizada principalmente por CYP3A4, con contribución de CYP2D6. Las actividades de estas vías metabólicas pueden ser inhibidas o inducidas por diversos fármacos co-administrados conjuntamente o elementos dietéticos. Las dosis de Oxycodona pueden necesitar ser ajustadas por consiguiente.

Inhibidores CYP3A4, tales como antibióticos macrólidos (p. ej., claritromicina), agentes antifúngicos azoles (por ejemplo, ketoconazol), inhibidores proteasa (p. ej., ritonavir) y jugo de pomelo pueden causar una disminución del aclaramiento de Oxycodona que podría conducir a un aumento en las concentraciones plasmáticas de Oxycodona.

Inductores de CYP3A4, tales como rifampicina, carbamazepina, fenitoína y hierba de San Juan, pueden inducir el metabolismo de Oxycodona y causar aumento de la depuración de la droga, lo que resulta en una disminución de las concentraciones plasmáticas de Oxycodona.

Drogas que inhiben la actividad de CYP2D6, como la paroxetina y quinidina, pueden causar disminución de espacio de Oxycodona que podría conducir a un aumento en las concentraciones plasmáticas de Oxycodona.

### *Incompatibilidades*

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL

---

Ciclizina en concentraciones de 3 mg/mL o menos, cuando se mezcla con Oxyrapid inyectable, ya sea sin diluir o diluido con agua para inyectables, no muestra signos de precipitación en un periodo de 24 horas de almacenamiento a temperatura ambiente.

Se ha demostrado que se produce precipitación en mezclas de Oxyrapid con concentraciones mayores de ciclizina 3 mg/ml o cuando se diluye con 0,9% de solución salina.

Se recomienda que el agua para las inyecciones sea utilizado como diluyente cuando la ciclizina y el clorhidrato de Oxycodona son co-administrados por vía intravenosa o por vía subcutánea como perfusión.

### FERTILIDAD, EMBARAZO Y LACTANCIA

**Hay datos clínicos limitados sobre el uso de oxycodona en embarazadas. En niños nacidos de madres que han recibido opioides durante las 3-4 semanas anteriores al nacimiento se deben monitorizar por el riesgo de depresión respiratoria. Se puede observar síndrome de abstinencia en recién nacidos de madres en tratamiento con oxycodona. La oxycodona atraviesa la placenta. La oxycodona no debe utilizarse durante el embarazo ni el parto ya que puede alterar la contractibilidad uterina y por el riesgo de depresión respiratoria neonatal. La oxycodona se puede excretar en la leche materna y puede causar depresión respiratoria en el recién nacido. Por tanto, oxycodona no debe usarse en madres lactantes.**

### REACCIONES ADVERSAS

Los efectos indeseables enumerados a continuación son clasificados por el sistema corporal según su incidencia. Las siguientes frecuencias son base para evaluar los efectos indeseables:

Muy común ( $\geq 1/10$ ); Común ( $\geq 1/100$  a  $< 1/10$ ); Inusual ( $\geq 1/1.000$  a  $< 1/100$ ); Raro ( $\geq 1/10.000$  a  $< 1/1.000$ ); Muy raro ( $< 1/10.000$ ); No conocido (no puede estimarse a partir de los datos disponibles)

Los efectos indeseables enumerados a continuación son clasificados por el sistema corporal según su incidencia (común o inusual). Las reacciones adversas comunes de la droga tienen una incidencia de  $\geq 1\%$  y las experiencias adversas inusuales de la droga tienen una incidencia de  $< 1\%$ .



**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

- Trastornos del sistema inmunológico	
Inusual	Hipersensibilidad
No conocido	Reacción anafiláctica Reacción anafilactoide
- Trastornos del metabolismo y nutrición	
Común	Disminución del apetito
Inusual	Deshidratación
- Trastornos psiquiátricos	
Común	Ansiedad Estado confusional Insomnio Nerviosismo Pensamiento anormal Depresión
Inusual	Labilidad afectiva Agitación Estado de ánimo eufórico Alucinación Disminución de la libido Dependencia de las drogas Agresión
No conocido	
- Trastornos del sistema nervioso	
Muy común	Mareo Dolor de cabeza Somnolencia
Común	Temblor Letargo
Inusual	Amnesia Convulsión Hipertonía Hipoestesia Contracciones musculares involuntarias Parestesia

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

	Trastorno del habla
	Síncope
	Disguesia
No conocido	Hiperalgnesia
- Trastornos oculares	
Inusual	Miosis
	Discapacidad visual
- Trastornos del oído y laberinto	
Inusual	Vértigo
- Trastornos cardíacos	
Inusual	Palpitaciones (en el contexto del síndrome de abstinencia)
- Trastornos vasculares	
Inusual	Vasodilatación
Raro	Hipotensión
	Hipotensión ortostática
- Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	
Común	Disnea
Inusual	Depresión respiratoria
- Trastornos gastrointestinales	
Muy común	Estreñimiento
	Nauseas
	Vómitos
Común	Dolor abdominal
	Diarrea
	Boca seca
	Dispepsia
Inusual	Disfagia
	Erucción
	Flatulencia
	íleo
No conocido	Caries dental
- Trastornos hepatobiliares	

## FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL

---

Inusual	Enzimas hepáticas aumentada
No conocido	Colestasis
- Trastornos de piel y tejidos subcutáneos	
Muy común	Prurito
Común	Hiperhidrosis
	Erupción
Inusual	Piel seca
Raro	Urticaria
- Trastornos renales y urinarios	
Inusual	Retención urinaria
- Trastornos del aparato reproductor y de mama	
Inusual	Disfunción eréctil
	Hipogonadismo
No conocido	Amenorrea
- Trastornos generales y en el lugar de administración	
Común	Astenia
	Fatiga
Inusual	Escalofríos
	Síndrome de abstinencia de drogas
	Edema
	Edema periférico
	Malestar
	Sed
	Tolerancia de la droga
No conocido	Síndrome de abstinencia a la droga en neonatales

### **SOBREDOSIS**

Puede manifestarse sobredosis aguda con Oxidona por depresión respiratoria, somnolencia que progresa a estupor o coma, hipotonía, miosis, bradicardia, hipotensión, edema pulmonar y la muerte.

Ref.: RF793346/16

Reg. I.S.P. N° F-23489/17

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

Debe mantenerse una vía aérea patente. Los antagonistas puros opiáceos como la naloxona son antídotos específicos contra los síntomas de sobredosis de opiáceos. Deberán utilizarse otras medidas de apoyo según sea necesario.

**ALMACENAMIENTO**

Conserve a temperatura inferior a 30 °C

**Medicamento diluido: Si es diluido con condiciones asépticas validadas es estable por 24 horas almacenado entre 2°C y 8°C.**

**PRESENTACIÓN**

Caja con X viales de 1mL con 10 mg

Fecha de última revisión: Marzo 2016

**MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.**

Periodo de validez: 24 meses

**ELABORADO POR:** Rafa Laboratories Limited, 3 Ze'ev Lev St. Har Hotzvim Ind Zone, Jerusalén - Israel

**PARA:** Mundipharma Laboratories GmbH, St. Alban-Rheinweg 74, CH-4020, Basilea, Suiza.

<Mundipharma logo>

Bolivia

Venta bajo receta médica archivada

Reg. San.:

Importado/distribuído por:

**Ref.: RF793346/16                      Reg. I.S.P. N° F-23489/17**  
**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**  
**OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

Chile

Venta bajo receta cheque. Sujeto a control de estupefacientes

Reg. ISP.:

**Importado por:** Alpes Chemie S.A., Av. Isidora Goyenechea 3162 Of. 803 Las Condes – Santiago

**Distribuido por:** Droguería de Laboratorios Euromed Chile S.A., Caupolicán 9291 Bodegas D, E F, G, Quilicura, Santiago.

Mayor información: [www.ispch.cl](http://www.ispch.cl)

Ecuador

Venta bajo receta controlada

Reg. San.:

No. C.U.M.: 1790371506001

Paraguay:

Venta bajo receta cuadruplicada

Venta autorizada por el M.S.P y B.S.

Reg. San.:

Empresa solicitante:

Regente:

Uruguay:

Venta bajo receta profesional

Reg. San.:

Farmacéutico responsable:

Venezuela

Venta con prescripción facultativa y récipe archivado

Reg. San.:

Advertencias: Producto de uso delicado que solo debe ser administrado bajo control del facultativo. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, ni durante el periodo de lactancia. Antes de usar el producto es importante leer las advertencias que aparecen en el prospecto interno. La vía intravenosa solo debe ser usada cuando está formalmente indicada, cuando la urgencia la requiera y/o cuando este contraindicada otra vía de administración,

**Ref.: RF793346/16                      Reg. I.S.P. N° F-23489/17**  
**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**  
**OXYRAPID SOLUCIÓN INYECTABLE 10 mg/1 mL**

---

preferentemente en pacientes hospitalizados y bajo supervisión del médico Importado/Distribuido por:

Farmacéutico patrocinante: